



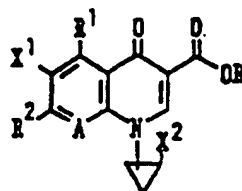
BEST AVAILABLE COPY

<p>(51) 国際特許分類6</p> <p><b>C07D 401/04, 471/04, A61K 31/435, 31/47</b></p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 <b>WO96/23782</b></p> <p>(43) 国際公開日 <b>1996年8月8日 (08.08.96)</b></p>											
<table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 45%; vertical-align: top;"> <p>(21) 国際出願番号 <b>PCT/JP96/00208</b></p> <p>(22) 国際出願日 <b>1996年2月1日 (01.02.96)</b></p> <p>(30) 優先権データ</p> <table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 30%;">特願平7/15614</td> <td style="width: 30%;">1995年2月2日 (02.02.95)</td> <td style="width: 40%;">JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19478</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19481</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者：および</p> <p>(75) 発明者／出願人 (米国についてのみ)</p> <p>竹村 真(TAKEMURA, Makoto)(JP/JP)</p> <p>木村陽一(KIMURA, Youichi)(JP/JP)</p> <p>川上勝浩(KAWAKAMI, Katsuhiko)(JP/JP)</p> <p>木村健一(KIMURA, Kenichi)(JP/JP)</p> <p>大木 仁(OHKI, Hitoshi)(JP/JP)</p> <p>松橋範一(MATSUHASHI, Nonikazu)(JP/JP)</p> </td> <td style="width: 55%; vertical-align: top;"> <p>川戸晴子(KAWATO, Haruko)(JP/JP) 〒134 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 萩野 平, 外(HAGINO, Taira et al.) 〒107 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 CA, CN, FI, KR, NO, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 <span style="float: right;">国際調査報告書</span></p> </td> </tr> </table>			<p>(21) 国際出願番号 <b>PCT/JP96/00208</b></p> <p>(22) 国際出願日 <b>1996年2月1日 (01.02.96)</b></p> <p>(30) 優先権データ</p> <table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 30%;">特願平7/15614</td> <td style="width: 30%;">1995年2月2日 (02.02.95)</td> <td style="width: 40%;">JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19478</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19481</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者：および</p> <p>(75) 発明者／出願人 (米国についてのみ)</p> <p>竹村 真(TAKEMURA, Makoto)(JP/JP)</p> <p>木村陽一(KIMURA, Youichi)(JP/JP)</p> <p>川上勝浩(KAWAKAMI, Katsuhiko)(JP/JP)</p> <p>木村健一(KIMURA, Kenichi)(JP/JP)</p> <p>大木 仁(OHKI, Hitoshi)(JP/JP)</p> <p>松橋範一(MATSUHASHI, Nonikazu)(JP/JP)</p>	特願平7/15614	1995年2月2日 (02.02.95)	JP	特願平7/19478	1995年2月7日 (07.02.95)	JP	特願平7/19481	1995年2月7日 (07.02.95)	JP	<p>川戸晴子(KAWATO, Haruko)(JP/JP) 〒134 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 萩野 平, 外(HAGINO, Taira et al.) 〒107 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 CA, CN, FI, KR, NO, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 <span style="float: right;">国際調査報告書</span></p>
<p>(21) 国際出願番号 <b>PCT/JP96/00208</b></p> <p>(22) 国際出願日 <b>1996年2月1日 (01.02.96)</b></p> <p>(30) 優先権データ</p> <table style="width: 100%;"> <tr> <td style="width: 30%;">特願平7/15614</td> <td style="width: 30%;">1995年2月2日 (02.02.95)</td> <td style="width: 40%;">JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19478</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平7/19481</td> <td>1995年2月7日 (07.02.95)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)(JP/JP) 〒103 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者：および</p> <p>(75) 発明者／出願人 (米国についてのみ)</p> <p>竹村 真(TAKEMURA, Makoto)(JP/JP)</p> <p>木村陽一(KIMURA, Youichi)(JP/JP)</p> <p>川上勝浩(KAWAKAMI, Katsuhiko)(JP/JP)</p> <p>木村健一(KIMURA, Kenichi)(JP/JP)</p> <p>大木 仁(OHKI, Hitoshi)(JP/JP)</p> <p>松橋範一(MATSUHASHI, Nonikazu)(JP/JP)</p>	特願平7/15614	1995年2月2日 (02.02.95)	JP	特願平7/19478	1995年2月7日 (07.02.95)	JP	特願平7/19481	1995年2月7日 (07.02.95)	JP	<p>川戸晴子(KAWATO, Haruko)(JP/JP) 〒134 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo, (JP)</p> <p>(74) 代理人 弁理士 萩野 平, 外(HAGINO, Taira et al.) 〒107 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 CA, CN, FI, KR, NO, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p>添付公開書類 <span style="float: right;">国際調査報告書</span></p>			
特願平7/15614	1995年2月2日 (02.02.95)	JP											
特願平7/19478	1995年2月7日 (07.02.95)	JP											
特願平7/19481	1995年2月7日 (07.02.95)	JP											

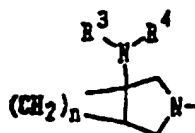
BEST AVAILABLE COPY

(54) Title : HETEROCYCLIC COMPOUNDS

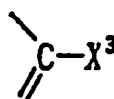
(54) 発明の名称 複素環式化合物



(I)



(II)



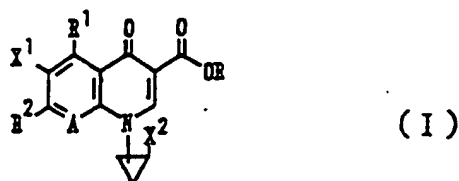
(III)

(57) Abstract

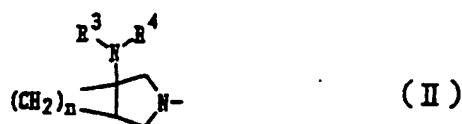
$N_1$ -(Halogenocyclopropyl)-substituted pyridonecarboxylic acid derivatives represented by general formula (I), heterocyclic compounds useful as antibacterial agents, wherein  $X^1$  represents halo or hydrogen;  $X^2$  represents halo;  $R^1$  represents hydrogen, hydroxy, thiol, halomethyl, amino, alkyl or alkoxy;  $R^2$  represents a group of general formula (II) (wherein  $R^3$  and  $R^4$  represent each hydrogen or alkyl; and  $n$  represents an integer of 1 or 2);  $A$  represents nitrogen or a group of general formula (III), (wherein  $X^3$  represents halo, cyano, amino, alkyl, halomethyl, alkoxy or halomethoxy); and  $R$  represents hydrogen, phenyl, acetoxymethyl, pivaloyloxymethyl, ethoxycarbonyl, choline, dimethylaminoethyl, 5-indanyl, phthalidyl, 5-alkyl-2-oxo-1, 3-dioxol-4-ylmethyl, 3-acetoxy-2-oxobutyl, alkyl, alkoxyethyl or phenylalkyl.

## (57) 要約

本発明は、一般式 (I) で表されるN, - (ハロゲノシクロプロピル) 置換ピリドンカルボン酸誘導体に関し、抗菌剤として有用な複素環式化合物を提供する。



[式中、X¹ はハロゲン原子またはH、X² はハロゲン原子、R¹ はH、水酸基、チオール基、ハロゲノメチル基、アミノ基、アルキル基またはアルコキシル基、R² は式 (II)]



(式中、R³ およびR⁴ は、Hまたはアルキル基、nは1または2の整数。)、AはNまたは式 (III)]



[X³ はH、ハロゲン原子、シアノ基、アミノ基、アルキル基、ハロゲノメチル基、アルコキシル基、またはハロゲノメトキシ基を表す。]、Rは水素原子、フェニル基、アセトキシメチル基、ピバロイルオキシメチル基、エトキシカルボニル基、コリン基、ジメチルアミノエチル基、5-インダニル基、フタリジニル基、5-アルキル-2-オキソ-1, 3-ジオキサール-4-イルメチル基、3-アセトキシ-2-オキソブチル基、アルキル基、アルコキシメチル基またはフェニルアルキル基を表す。]

## 情報としての用途のみ

PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

AL	アルバニア	DE	ドイツ	LI	リヒテンシュタイン	PL	ポーランド
AM	アルメニア	DK	デンマーク	LC	セントルシア	PT	ポルトガル
AT	オーストリア	EE	エストニア	LK	スリランカ	RO	ルーマニア
AU	オーストラリア	ES	スペイン	LR	リベリア	RU	ロシア連邦
AZ	アゼルバイジャン	FI	フィンランド	LS	レソト	SD	スーダン
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	FR	フランス	LT	リトアニア	SE	スウェーデン
BB	バルバドス	GA	ガボン	LU	ルクセンブルグ	SG	シンガポール
BE	ベルギー	GB	イギリス	LV	ラトヴィア	SI	スロヴェニア
BG	ブルガリア	GE	グルジア	MC	モナコ	SK	スロヴァキア
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	MD	モルドヴァ共和国	SN	セネガル
BY	ベラルーシ	HU	ハンガリー	MG	マダガスカル	SZ	スワジランド
CA	カナダ	IE	アイルランド	MK	マケドニア共和国	TD	チャド
CC	中央アフリカ共和国	IL	イスラエル	ML	マリ	TG	トーゴ
CG	コンゴ	IT	イタリア	MN	モンゴル	TJ	タジキスタン
CH	スイス	JP	日本	MR	モーリタニア	TM	トルクメニスタン
CI	コート・ジボアール	KE	ケニア	MW	マラウイ	TR	トルコ
CN	中国	KG	キルギスタン	MX	メキシコ	TT	トリニダード・トバゴ
CU	キューバ	KP	朝鮮民主主義人民共和国	NE	ニジェール	UA	ウクライナ
CZ	チェコ共和国	KR	大韓民国	NL	オランダ	UG	ウガンダ
		KZ	カザフスタン	NO	ノルウェー	US	アメリカ合衆国
				NZ	ニュージーランド	UZ	ウズベキスタン
						VN	ヴェトナム